

This Page Is Inserted by IFW Operations
and is not a part of the Official Record

BEST AVAILABLE IMAGES

Defective images within this document are accurate representations of the original documents submitted by the applicant.

Defects in the images may include (but are not limited to):

- BLACK BORDERS
- TEXT CUT OFF AT TOP, BOTTOM OR SIDES
- FADED TEXT
- ILLEGIBLE TEXT
- SKEWED/SLANTED IMAGES
- COLORED PHOTOS
- BLACK OR VERY BLACK AND WHITE DARK PHOTOS
- GRAY SCALE DOCUMENTS

IMAGES ARE BEST AVAILABLE COPY.

**As rescanning documents *will not* correct images,
please do not report the images to the
Problem Image Mailbox.**

1～6項前条のいずれかによる化合物。

8. R_1 , R_2 , がハロゲン、フッ素、塩素、トリフルオルメチル、メチルまたはメトキシである際の特許請求の範囲第1～7項前条のいずれかによる化合物。

9. R_1 , R_2 , がセレン、碲、トリフルオルメチル、メチルまたはメトキシである際の特許請求の範囲第8項前条の化合物。

10. R_1 , R_2 , 及び R_3 , が各々水素であり、そして R_4 , がメチルである際の特許請求の範囲第1項前条の式1の化合物。

11. R_1 , 及び R_2 , が各々水素であり、 R_3 , がメチルであり、そして R_4 , が p -クロルである際の特許請求の範囲第1項前条の式1の化合物。

12. R_1 , 及び R_2 , が各々水素であり、 R_3 , がメチルであり、そして R_4 , が p -フルオルである

メチルであり、そして R_5 , が p -フルオルである際の特許請求の範囲第1項前条の式1の化合物。

13. R_1 , 及び R_2 , が各々水素であり、 R_3 , がメチルであり、そして R_4 , が m -メチルである際の特許請求の範囲第1項前条の式1の化合物。

14. R_1 , 及び R_2 , が各々水素であり、 R_3 , がメチルであり、そして R_4 , が m -メトキシである際の特許請求の範囲第1項前条の式1の化合物。

20. R_1 , 及び R_2 , が各々水素であり、 R_3 , がメチルであり、そして R_4 , が m -トリフルオルメチルである際の特許請求の範囲第1項前条の式1の化合物。

21. R_1 , 及び R_2 , が各々水素であり、 R_3 , がメチルであり、そして R_4 , が o -メチルである際の特許請求の範囲第1項前条の式1の化合物。

特開51-113877 (2)

特開51-113877 (2)の特許請求の範囲第1項前条の式1の化合物。

13. R_1 , 及び R_2 , が各々水素であり、 R_3 , がメチルであり、そして R_4 , が m -メチルである際の特許請求の範囲第1項前条の式1の化合物。

14. R_1 , 及び R_2 , が各々水素であり、 R_3 , がメチルであり、そして R_4 , が p -メトキシである際の特許請求の範囲第1項前条の式1の化合物。

15. R_1 , 及び R_2 , が各々水素であり、 R_3 , がメチルであり、そして R_4 , が m -トリフルオルメチルである際の特許請求の範囲第1項前条の式1の化合物。

16. R_1 , 及び R_2 , が各々水素であり、 R_3 , がメチルであり、そして R_4 , が p -クロルである際の特許請求の範囲第1項前条の式1の化合物。

17. R_1 , 及び R_2 , が各々水素であり、 R_3 , が

22. R_1 , が水素であり、 R_2 , がメチルであり、 R_3 , が p -クロルであり、そして R_4 , が p -クロルである際の特許請求の範囲第1項前条の式1の化合物。

23. R_1 , が p -クロルであり、 R_2 , が水素であり、 R_3 , がメチルであり、そして R_4 , が p -クロルである際の特許請求の範囲第1項前条の式1の化合物。

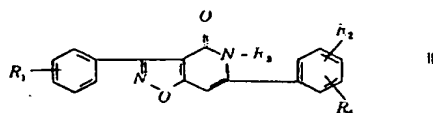
24. 遊離ヒドロキシ型における特許請求の範囲第1～28項前条のいずれかによる化合物。

25. 塩化付加塩の型における特許請求の範囲第1～28項前条のいずれかによる化合物。

26. アルカリまたはアルカリ土金属塩の型における特許請求の範囲第25項前条の化合物。

27. 遊離ヒドロキシ型または塩化付加塩型

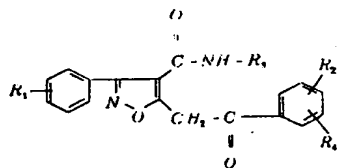
28. 式日:



の化合物を不飽和脂肪酸中で還元することを知

で知らされる化合物。

80. 式 2.



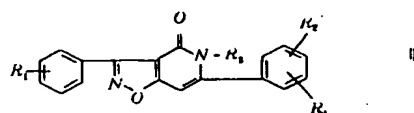
の化合物を係ねばぬの存在下において形式化する
ることから左を酢酸中の細胞第2相形成の式
Ⅱの化合物の製造方法。

8 1. 式 Ⅱ .

*c1ccc(cc1)C(=O)c2c(O)cnc2-c3ccc(cc3)R2

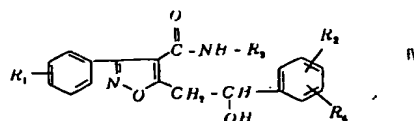
の仕方を示す方法。

29 式 例 .


$$\begin{array}{c}
 O \\
 || \\
 R_1 - \text{C}_6\text{H}_4 - \text{C} - \text{NH} - R_2 \\
 \quad \quad \quad | \\
 \quad \quad \quad N - O \\
 \quad \quad \quad | \\
 \quad \quad \quad CH_2 - C - \text{C}_6\text{H}_4 - R_3 \\
 \quad \quad \quad || \\
 \quad \quad \quad O
 \end{array}$$

て改められる社会だ。

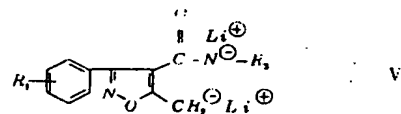
式, 11



～4個のアルキルである、

で表わされる化合物。

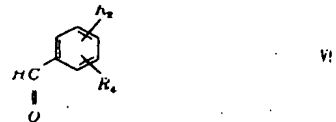
8.4. 式V.



式中、 R_1 、及び R_2 は特許請求の範囲第

8.8項に示した追加のものである、

の化合物を不活性有機酸中で式V、



式中、 R_2 、及び R_4 は特許請求の範囲第

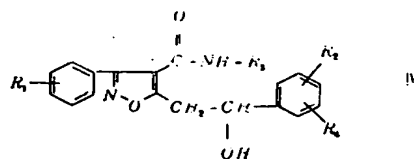
8.8項に示した追加のものである、

の化合物と反応させることからなる特許請求の範囲

式中、 R_1 、 R_2 、 R_3 、及び R_4 は特許請求の範囲第8.1項に示した追加のものである、

の化合物を塩化するとからなる特許請求の範囲第8.1項に示した追加のものである、

8.3. 式II.



式中、 R_1 、 R_2 、及び R_4 は同一もしくは互

異なるものであることができ、各々水素、

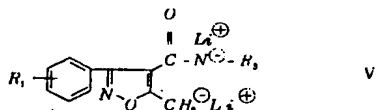
フッ素、塩素、トリフルオルメチルまたは

炭素原子1～4個のアルキルもしくはアル

コキシを被せ、そして R_3 は炭素原子1

特開第8.8項に示した追加のものである、

8.5. 式V.



式中、 R_1 は水素、フッ素、塩素、トリフ

ルオルメチルまたは炭素原子1～4個のアル

キルもしくはアルコキシを被せ、そして

て R_2 は炭素原子1～4個のアルキルであ

る、

で表わされる化合物。

8.6. 反応する8-フェニル-N-アルキル-

5-メチルインキサゾロ-4-カルボキシアミド

を不活性有機酸中で式V、アルキルリチウム

と反応させることからなる特許請求の範囲第8.5

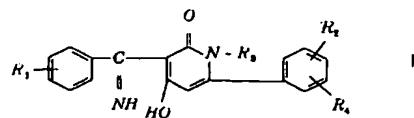
特開第8.8項に示した追加のものである、

8.6. 反応する特許請求の範囲

本発明は8-(α -イミノベンジル)-4-ヒ

ドロキシ-2(1H)-ピリドン誘導体に関する。

本発明は本発明は式I、



式中、 R_1 、 R_2 、及び R_4 は同一もしくは互

異なるものであることができ、各々水素、

フッ素、塩素、トリフルオルメチルまたは

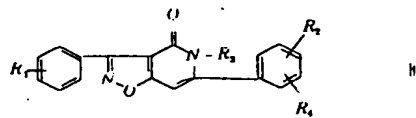
炭素原子1～4個のアルキルもしくはアル

コキシを被せ、そして R_3 は炭素原子1

～4個のアルキルである、

の化合物を提供する。

また本発明式Ⅱ、

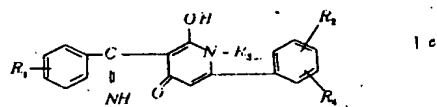
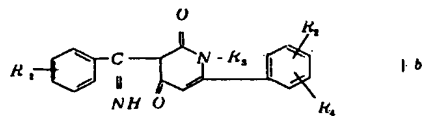


式中、 R_1 、 R_2 、 R_3 、及び R_4 は上記定

義した如きものである、

の化合物を不活性な溶剤中にて還元することからなる式Ⅰの化合物の製造方法を提議する。

本方法は普通の方法において、例えば銅が還元剤添加によつて行なうことができる。適切な酸媒には炭素酸塩またはパラジウム、酸化白金及びラネーニッケルが含まれ、好ましくは炭素酸塩またはパラジウムである。不活性な溶剤の例は例えばアルカノール、例えばメタノール、または好ましくはエタノールが普通に使われる。本要約



式中、 R_1 、 R_2 、 R_3 、及び R_4 は上記定

義した如きものである、

の互変異性体として併用される。

上記及び添付図において本発明式Ⅰの如き又は類似する化学名のみを示したか、不活性な化合物の存在の如に、或いは純粋または用途に限定する必要のないことを理解すべきである。

式Ⅱの化合物は式Ⅱ、

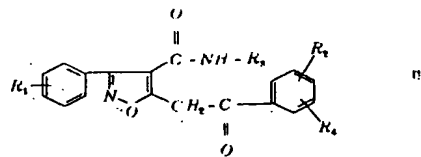
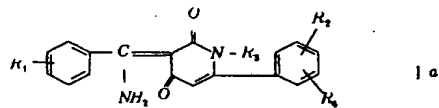
特開第51-113877(5)

加熱10°～50℃、好ましくは20°～80℃

の範囲で有利に行なわれ、反応時間は例えば1～10時間、中間溶媒は2～8時間の範囲であるとかである。

生じた式Ⅰの化合物は普通の方法を用いて単離し、そして提純することができる。必要に応じて該化合物の高純ヒドロキシ基を普通の方法で炭基付加基に交換することができ、そしてまたその逆も可能である。

おらかなど、式Ⅰの化合物は式Ⅰa、Ⅰb及びⅠc、



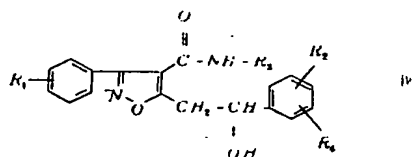
式中、 R_1 、 R_2 、 R_3 、及び R_4 は上記定

義した如きものである、

の化合物を所定の溶剤の存在下において提式化し、提式することができる。

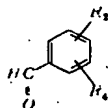
この式化は普通の方法において、例えば式Ⅱの化合物を、例えば炭化水素、カーボン、スチレン、ポリリン酸または好ましくは炭酸、且つ炭酸は不活性な溶剤は炭酸水素水、例えばベンゼンまたはトルエン中で処理して行なうことができる。しかしながら、好ましくは炭酸の存在下において、炭酸を処理することができる。と

式 9 的 1 个 食 物 链 式 如



この条件は数値の条件において、例えば満マン

の化合物を不飽和化合物として式Ⅱ、



フジニル - N - アルキル - 5 - メチル - イソキサ

$$\begin{array}{c}
 \text{O} \\
 \parallel \\
 \text{C} - \text{N}^{\ominus} - \text{R}_2 \\
 \parallel \\
 \text{N} - \text{O} - \text{C} \text{H}_2 - \text{L}^{\oplus} \\
 \parallel \\
 \text{R}_1 - \text{C}_6\text{H}_4
 \end{array}$$

式中、 R_1 及び R_2 は上記定義した如き電

1) ウィンター (Winter), J. Pharmacol.

and Exp. Therap. 94, 7~11 (1948)
 のヘキソバルビターA無効法; 2) エス・イル
 ビン (S. Irwin) (Gordon Research
 Conference, Medicinal Chemistry, 195
 9) とリナエン (Chen) (Symposium on
 Sedative and Hypnotic Drugs, Williams
 and Wilkins, 1954) によつて本剤の試
 べられたものは30ワード・アジェクティブ・チエ
 ック・シート・システム (30-word adjec
 tive check sheet system) に従い、マウス
 の試薬化合物 25~200mg/kg 動物体重を腹腔
 内に投与した後に行動観察において鎮静性を生じる
 その作用; 8) マウスに試薬化合物 85mg/kg
 を腹腔内に投与し併せて他剤に N-スルファモイル
 アセヒン 45~250mg/kg を腹腔内に投与した際

に於いて、指示された適量な1日当りの投与量
 は 85~1000mg であり、この量を 8~
 500mg の分制投与量で1日2~4回に投与する
 とすることができるが、しかし好ましくは就寝時刻に1
 回の投与量として投与する。該剤のトランキライ
 ザー作用に対しては、指示された1日当りの投与
 量の半分は 80~1500mg であり、通常には
 75~750mg の分制投与量で1日2~4回に、
 或いは無知量の形で投与する。

本化合物は炭酸ヒドロキシ酸で取れば無毒的
 に溶解し、殆ど無毒な塩の形で投与することがで
 き、該塩は該塩酸と同程度の毒性を示す。該
 塩の形態にはアルカリ金属塩、炭酸リチウム、ナ
 トリウム及びカリウム塩、並びにアルカリ土金
 属塩、炭酸マグネシウムまたはカルシウム塩が

特開551-113877 (7)
 鎮静性作用及び死後鎮静作用; 4) マウ
 スにナトリウム 125mg/kg を腹腔内に投与し、そ
 の後に試薬化合物 61mg/100g 体重の割合で
 おける 5~100mg/kg の割合で投与するリー
 ド・ムエンチ (Lead-Muench) [American
 Journal of Hygiene, 27, 498~497,
 (1938)] の方法による正位投与の損失に對
 する試験。投与して60分後、マウスを正位投与
 の損失に對して試験する; 並行に 5) クラー・ゲル
 試験 (Geller Conflict test) [Irving
 Geller, Psychopharmacologia, 1, 42~
 492 (1950)] に従って投与された如き競争を
 生ずるその作用。

従つて本化合物は睡眠鎮痛剤及び鎮痛剤トラン
 キライザー用に適応する。睡眠鎮痛剤としての用

言される。

本化合物は普通の製剤形態に於ける錠剤及び
 注射液、並びに該化合物によつて該他の製剤形態に配合す
 ることができる、かたくり錠剤カプセル剤及び錠剤
 の形態で投与することができる。

式1の製造法化合物は、~が、が次の意味を
 与えるものである:

R₁ = 水素、塩素、フッ素、トリフルオルメチ
 ル、メチルまたはメトキシ、炭酸水素ま
 たは炭酸、炭酸水素;

R₂ = 水素;

R₃ = 水素、塩素、フッ素、トリフルオルメチ
 ル、メチルまたはメトキシ、炭酸水素、
 炭酸、トリフルオルメチル、メチルま
 たはメトキシ;

6. 添付書類の目録

1. 明 細 書	1 通
特 許 証 書	1 通
2. 委任状及びその訳文	各 1 通
横渡証書及びその訳文	各 1 通
国籍及び法人証明書並びにこれらの訳文	各 1 通
3. 履歴証明書及びその訳文	各 2 通
	8 枚綴

7. 前記以外の発明者、特許出願人または代理人

(1) 発 明 者

姓 名

氏 名

住 所

正 名